

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局(43)国際公開日  
2005年3月31日 (31.03.2005)

PCT

(10)国際公開番号  
WO 2005/028438 A1(51)国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 211/58, 401/06, 401/14, 401/02, 401/12, 409/12, A61K 31/4545, 31/496, 31/454, 31/4523, 31/4535, 31/506, A61P 43/00, 3/04, 3/10, 5/00, 3/06, 19/06, 9/10, 9/04, 9/12, 13/12, 25/20, 25/24, 25/22, 25/08, 25/18, 25/28, 25/16, 25/02, 25/32, 25/36

(21)国際出願番号: PCT/JP2004/013768

(22)国際出願日: 2004年9月21日 (21.09.2004)

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:  
特願2003-330758 2003年9月22日 (22.09.2003) JP

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038416 東京都中央区日本橋本町二丁目2番3号 Tokyo (JP).

(72)発明者; および

(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 大嶽憲一 (OHTAKE, Norikazu) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 水谷清香 (MIZUTANI, Sayaka) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 善本亮 (YOSHIMOTO, Ryo) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 鶴田滋 (TOKITA, Shigeru) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製

薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 金谷 章生 (KANATANI, Akio) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP).

(74)代理人: 廣田 雅紀, 外 (HIROTA, Masanori et al.); 〒1070052 東京都港区赤坂二丁目8番5号 若林ビル3階 Tokyo (JP).

(81)指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

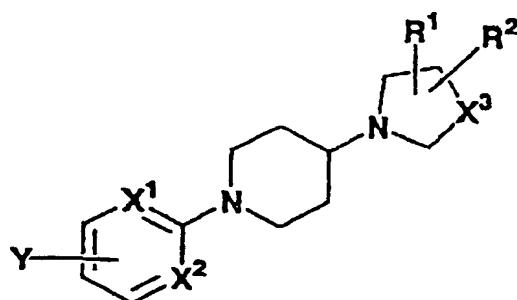
(84)指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。

(54)Title: NOVEL PIPERIDINE DERIVATIVE

(54)発明の名称: 新規ピペリジン誘導体



(1)

(57)Abstract: A histamine H3-receptor antagonist; and a therapeutic and/or preventive agent for metabolic diseases, e.g., obesity and diabetes, various diseases such as, e.g., angina pectoris and acute/congestive heart failure, circulatory diseases such as, e.g., idiopathic narcolepsy and recurrent narcolepsy, and central and peripheral nerve diseases such as, e.g., bulimia, affective disorders, and depression. The histamine H3-receptor antagonist

is characterized by containing a piperidine derivative represented by the general formula (I) [wherein X<sup>1</sup> and X<sup>2</sup> each independently represents nitrogen or CH; Y represents a specific group; X<sup>3</sup> represents O<sub>s</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>; R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> each independently represents hydrogen, halogeno, linear or branched lower alkyl, lower alkoxy, or acetyl substituted by 2 or 3 fluorine atoms; s is 0 or 1; and m is such an integer that (m+s) is 0 to 4] or a pharmaceutically acceptable salt of the derivative.

[統葉有]

WO 2005/028438 A1



## (57) 要約:

ヒスタミンH3受容体アンタゴニストを提供し、肥満症、糖尿病、等の代謝系疾患、例えば狭心症、急性・うつ血性心不全等の各種疾患、例えば特発性過眠症、反復性過眠症等の循環器系疾患、例えば過食症、情動障害、うつ病等の中枢及び末梢神経系疾患の治療剤及び/又は予防剤を提供するものである。一般式(I) [式中、X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>は独立して窒素原子又はCHを示し、Yは特定の基を示し、X<sup>3</sup>はO、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>を示し、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、独立して水素原子、ハロゲン原子、直鎖若しくは分岐の低級アルキル基、低級アルコキシ基、又は2若しくは3のフッ素原子で置換されたアセチル基を示し、sは0又は1を示し、mは(m+s)が0又は1~4となる整数を示す。]で表されるピペリジン誘導体化合物又はその薬学的に許容される塩を含有することを特徴とするヒスタミンH3受容体アンタゴニスト。

## 【化1】

